

THIS PAGE BLANK (USPTO)

The Delphion Integrated View

Buy Now: ☒ PDF | [More choices...](#)Tools: Add to Work File: ☐ Create new Work File ☒ View: [INPADOC](#) | Jump to: [Top](#) Go to: [Derwent](#)☒ [Email this to a friend](#)

Title: JP2240023A2: PRODUCTION OF HIGH-PURITY CEPHALEXIN GRANULE AND POWDER

Derwent Title: High density cephalexin granules or powders prepn. - by compressing crystalline cephalexin powder at specific pressure between one pair of rollers etc. [\[Derwent Record\]](#)Country: JP Japan
Kind: A (See also: [JP6060100B4](#))Inventor: SUENAGA HIDEJI;
USHIJIMA SHUJI;
HARADA KENJI;Assignee: YOSHITOMI PHARMACEUT IND LTD
[News, Profiles, Stocks and More about this company](#)Published /
Filed: 1990-09-25 / 1989-03-13Application
Number: JP1989000061439IPC Code: [A61K 31/545](#); [A61K 9/14](#); [A61K 9/16](#); [C07D 501/22](#);

Priority Number: 1989-03-13 JP1989000061439

Abstract: PURPOSE: To obtain the title stable granule or powder industrially and in a large amount by subjecting raw material powder to contact bonding to rollers in a specific compression pressure, peeling the compression molded material by a scraper under a specific condition and granulating or powdering the prepared compressed molded material.

CONSTITUTION: Crystalline cephalexin powder is subjected to contact bonding between a pair of rollers mutually revolving in the opposite directions under 0.5-2.0t/cm compression pressure and attached to the rollers under pressure. The compressed molded material is peeled by a scraper kept 0.01mm-<1.00mm gap from the rollers and the prepared compressed molded material is granulated or powdered to give granule or powder having 0.45g/ml arbitrary bulk density.

COPYRIGHT: (C)1990,JPO&Japio

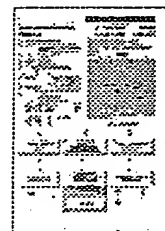
INPADOC Legal Status: None Buy Now: [Family Legal Status Report](#)

Family:

Buy PDF	Publication	Pub. Date	Filed	Title
<input checked="" type="checkbox"/>	JP6060100B4	1994-08-10	1989-03-13	
<input checked="" type="checkbox"/>	JP2240023A2	1990-09-25	1989-03-13	PRODUCTION OF HIGH-PURITY CEPHALEXIN GRANULE AND POWDER

2 family members shown above

Other Abstract Info: DERABS C90-332332 DERC90-332332

View
Image

1 page

⑨ 日本国特許庁(JP)

⑩ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報(A) 平2-240023

⑬ Int. Cl.⁵

識別記号

庁内整理番号

⑭ 公開 平成2年(1990)9月25日

A 61 K 31/545
// A 61 K 9/14
9/16
C 07 D 501/22

ADZ

C
R

7624-4C
7624-4C
8615-4C

審査請求 有 請求項の数 1 (全3頁)

⑮ 発明の名称 高密度セファレキシン顆粒または粉末の製造方法

⑯ 特 願 平1-61439

⑰ 出 願 平1(1989)3月13日

⑱ 発 明 者 末 永 秀 治 大分県中津市高瀬38-9
⑱ 発 明 者 牛 島 修 二 大分県中津市沖代町1丁目6-32
⑱ 発 明 者 原 田 健 次 福岡県豊前市三毛門町1188-3
⑲ 出 願 人 吉富製薬株式会社 大阪府大阪市中心区平野町二丁目6番9号
⑳ 代 理 人 弁理士 高宮城 勝

明 細 書

1. 発明の名称

高密度セファレキシン顆粒または粉末の製造方法

2. 特許請求の範囲

(1) 結晶性セファレキシン粉末を、互いに反対方向に回転する一対のローラー間で、0.5～2.0 t/cm²の圧縮圧で圧縮し、当該ローラーに圧着させ、ついで、ローラーとの間隙が0.01 mm以上、かつ、1.00 mm未満に保たれたスクレーバにより剝離させ、得られた圧縮成形物を顆粒または粉末化することを特徴とする高密度セファレキシン顆粒または粉末の製造方法。

3. 発明の詳細な説明

(産業上の利用分野)

本発明は、抗菌剤として汎用されているセファレキシンの高密度顆粒または粉末の製造方法に関する。

(従来の技術)

セファレキシンは、各種のグラム陽性菌および陰性菌に広範囲にわたって強力な抗菌作用を示す抗生物質であり、カプセル剤として使用されている。

一般に、カプセル剤は服用に際し、可及的に小型であることが好ましく、また、カプセルの規格は定められているため、主薬のカサ密度は大きい方が好ましい。

ところで、通常の方法により製造されるセファレキシンは、カサ密度0.15～0.2 g/cm³の結晶性粉末であり、高密度の顆粒または粉末を得る方法として、たとえば特開昭57-9785号または特公昭50-5255号公報に開示された高温晶出法が知られているが、経済的には有利な方法とは言い難い。

したがって、カプセルに充填しやすい、任意の高密度セファレキシン顆粒または粉末を経済的に製造する方法が確立されると、工業的に有利である。

(発明が解決しようとする課題)

本発明は、賦形剤などの添加剤を用いることなく、工業的に多量かつ安定した任意の高密度セファレキシン顆粒または粉末の製造方法を提供することを目的とする。

(課題を解決するための手段)

上記課題を解決するために、本発明者らは鋭意検討を行なった結果、本発明に到達した。すなわち、本発明は、結晶性セファレキシン粉末を、互いに反対方向に回転する一対のローラー間で、 $0.5 \sim 2 \text{ t/cm}$ の圧縮圧で圧縮し、当該ローラーとの間隙が 0.01 mm 以上、かつ 1.00 mm 未満に保たれたスクレーバにより剝離させ、得られた圧縮成形物を顆粒または粉末化することとを特徴とする高密度セファレキシン顆粒または粉末の製造方法に関する。

本発明方法を実施するに当たっては、粉体原料を貯槽下部に至るまで、ゆっくり沈降脱気させ、垂直リボンスクリューでかさ密度を低下させず、

このようにして、ローラーに圧着した結晶性セファレキシン粉末の圧縮成形物は、帯状または板状となっており、通常フレックと呼ばれている。このフレックをローラーから剝離するためには、スクレーバを用いるが、このスクレーバとローラーとの間隙を 0.01 mm 以上、かつ 1.00 mm 未満に保つことが本発明方法を実施するに当たり、重要な点の一つである。 0.01 mm 以下では、ロールへの接触傷をつける等、機械的トラブルの可能性があり、また 0.01 mm 以上では十分に剝離できなかったり、ローラー上に残った付着物により均一な圧縮成形ができないなどの問題がある。

得られる圧縮成形物は、常法により顆粒化または粉末化することにより、高密度セファレキシン顆粒または粉末が得られる。第1図に圧縮圧と本発明方法より得られるセファレキシンのかさ密度との関係を示す。この図面から明らかなように、本発明方法によると、かさ密度 0.45 g/cm 以上の均一な高密度製品が任意に製造される。さらに、

かつ水平スクリーユ予圧縮機で加圧し、原料中の高圧空気を排出後、一対のローラーで強圧を加えて密度の高い帯状物を得るロール圧縮造粒機を用いると好都合である。

本発明方法に適用される結晶性セファレキシン粉末は、通常の方法により製造されるもので、水分を 6.5% 以下含有している。 7% 以上を含有していると不安定であり、目的を達成することができない。また、賦形剤、滑沢剤などと混合する必要はなく、このような添加剤を使用しないことが本発明の特徴の一である。

このような結晶性セファレキシン粉末を、互いに反対方向に回転する一対のローラー間で圧縮するときの圧縮圧とは、油圧系によるローラーへの荷重がローラーの接線上で単位長さ当たり、圧縮成形物に垂直に及ぼす力であって、単位は g/cm 、 kg/cm または t/cm などで示す。

互いに反対方向に回転する一対のローラーは、上下方向に設置されているのが好ましい。

高密度製品を得るためには、再度圧縮してもよい。

〔作用および発明の効果〕

本発明方法によると、結晶性セファレキシン粉末から安定して任意の高密度セファレキシン顆粒または粉末を製造することができ、医薬製剤製造上きわめて有用である。

本発明は、原料粉末に滑沢剤などを添加せず、ローラーに圧着させ、ついで特定の条件下にスクレーバを用いて剝離させると、高密度セファレキシン顆粒または粉末が製造されるという新知見に基づいて、完成されたものである。

〔実施例〕

以下、実施例および比較例により、本発明を具体的に説明するが、本発明はそれらにより限定されるものではない。

実施例1

ローラーコンパクター（ターボ工業社製）を用い、圧縮圧を 1.15 t/cm に、ローラーとスクレーバとの間隙を 0.05 mm に設定して、かさ密度

0.15 g/mlのセファレキシン粉末を圧縮成形したところ、かさ密度0.55 g/mlのセファレキシンを得た。

実施例2

ローラーとスクレーバとの間隙を0.5 mmに設定した以外は、実施例1と同様にして、かさ密度0.15 g/mlのセファレキシン粉末を圧縮成形したところ、かさ密度0.55 g/mlのセファレキシンを得た。

比較例1

ローラーとスクレーバとの間隙を1.00 mmに設定した以外は、実施例1と同様にして、かさ密度0.15 g/mlのセファレキシン粉末を圧縮成形したところ、得られたセファレキシン粉末のかさ密度は0.38～0.45 g/mlであり、ローラーから剥離しない付着物によって均一な圧縮成形物ができなかった。

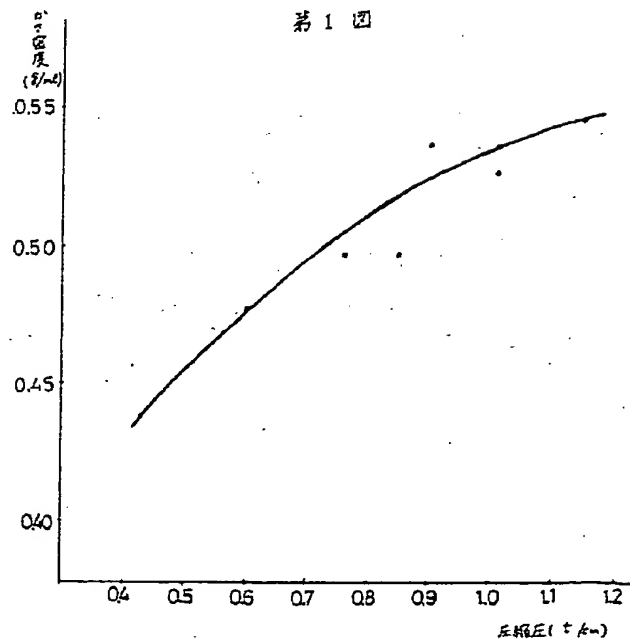
4. 図面の簡単な説明

第1図は、本発明方法により得られる高密度セ

ファレキシン顆粒または粉末のかさ密度（縦軸）と圧縮圧（横軸）との関係を示すグラフである。

特許出願人 吉 富 製 薬 株 式 会 社

代理人 弁 理 士 高 宮 城 勝



THIS PAGE BLANK (USPTO)